

有効期間：3 年

承認番号	22700AMX00588000
販売開始	2015 年 6 月

LOXOPROFEN Na Pump Spray [TCK]

- 1 -

人男子の背部に塗布したときの角層中未変化体量を測定した。得られた評価パラメータ（角層中未変化体量）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。

	評価パラメータ（角層中未変化体量（ $\mu\text{g}/3.14\text{cm}^2$ ））			
	2時間塗布	4時間塗布	6時間塗布	8時間塗布
ロキソプロフェンNa外用ポンプスプレー1%[TCK]	12.8 $\pm$ 6.7	14.4 $\pm$ 6.9	14.5 $\pm$ 6.4	16.1 $\pm$ 6.7
ロキソニンゲル1%	10.8 $\pm$ 4.0	11.3 $\pm$ 4.7	12.6 $\pm$ 5.2	13.2 $\pm$ 6.4

(Mean $\pm$ S.D., n=12)

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈変形性関節症の消炎・鎮痛〉

17.1.1 国内第Ⅱ相試験

変形性膝関節症患者を対象とした一般臨床試験において、ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg もしくは 200mg/ 日を 2 週間投与した結果、100mg 群での最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は 80.0%（44/55 例）、200mg 群での改善率は 79.7%（47/59 例）であった。副作用は 100mg 群で 4.7%（3/64 例）、200mg 群で 6.1%（4/66 例）に認められ、100mg 群での副作用は、紅斑、そう痒症、丘疹、発疹が各 1.6%（1/64 例）、200mg 群での主な副作用は、紅斑、そう痒症が各 3.0%（2/66 例）であった²⁾。

17.1.2 国内第Ⅲ相試験

(1) 変形性膝関節症患者を対象とした二重盲検試験において、ロキソプロフェンナトリウム錠 180mg/ 日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg/ 日を 4 週間投与した結果、ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群での最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は 77.9%（67/86 例）であった。副作用はロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群で 18.8%（16/85 例）に認められ、主な副作用は、腹部不快感 5.9%（5/85 例）、下痢、そう痒症が各 3.5%（3/85 例）であった³⁾。

(2) 変形性膝関節症患者を対象とした非盲検試験において、ケトプロフェンナトリウム貼付剤 60mg/ 日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg/ 日を 4 週間投与した結果、ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群での最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は 72.8%（107/147 例）であった。副作用はロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群で 10.0%（15/150 例）に認められ、主な副作用は、接触皮膚炎、 γ -GTP 増加が各 2.7%（4/150 例）、ALT 増加 2.0%（3/150 例）であった⁴⁾。

(3) 変形性膝関節症患者を対象とした一般臨床試験において、ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg/ 日を 12 ～ 24 週間投与した結果、最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は 73.3%（22/30 例）であった。副作用は 10.0%（3/30 例）に認められ、発現した副作用は接触皮膚炎、紅斑、皮下出血、そう痒症、発疹が各 3.3%（1/30 例）であった⁵⁾。

〈筋肉痛の消炎・鎮痛〉

17.1.3 国内第Ⅲ相試験

(1) 筋肉痛患者を対象とした二重盲検試験において、ロキソプロフェンナトリウム錠 180mg/ 日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg/ 日を 4 週間投与した結果、ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群での最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は 75.2%（82/109 例）であった。副作用はロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群で 9.4%（10/106 例）に認められ、主な副作用は、そう痒症 3.8%（4/106 例）、上腹部痛 2.8%（3/106 例）であった⁶⁾。

(2) 筋肉痛患者を対象とした非盲検試験において、インドメタシン貼付剤 140mg/ 日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウ

ム水和物パップ剤 100mg/ 日を 2 週間投与した結果、ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群での最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は 85.7%（102/119 例）であった。副作用はロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群で 5.0%（6/120 例）に認められ、主な副作用は、そう痒症 1.7%（2/120 例）であった⁷⁾。

〈外傷後の腫脹・疼痛〉

17.1.4 国内第Ⅲ相試験

外傷後の腫脹・疼痛患者を対象とした二重盲検試験において、ロキソプロフェンナトリウム錠 180mg/ 日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg/ 日を 7 日間投与した結果、ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群での最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は 98.1%（101/103 例）であった。副作用はロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群で 7.8%（8/102 例）に認められ、主な副作用は、そう痒症 2.9%（3/102 例）であった⁸⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

ロキソプロフェンナトリウム水和物は皮膚から吸収された後、活性代謝物 trans-OH 体に変換され、急性炎症・慢性炎症、疼痛に対して、優れた抗炎症・鎮痛作用を示す⁹⁾。

18.2 抗炎症作用

ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤をラットに貼付したとき、カラゲニン浮腫（急性炎症モデル）、アジュバント関節炎（慢性炎症モデル）のいずれに対しても有意な抗炎症作用を示した¹⁰⁾。

18.3 鎮痛作用

ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤をラットに貼付したとき、Randall-Selitto 法（炎症足加圧法）において、鎮痛作用を示した^{10),11)}。また、ラットのアジュバント慢性関節炎疼痛に鎮痛作用を示した¹²⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：ロキソプロフェンナトリウム水和物

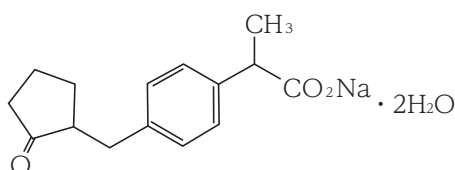
(Loxoprofen Sodium Hydrate)

化学名：Monosodium 2-[4-[(2-oxocyclopentyl)-methyl]phenyl]propanoate dihydrate

分子式： $\text{C}_{15}\text{H}_{17}\text{NaO}_3 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$

分子量：304.31

構造式：



性状：白色～帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

水又はメタノールに極めて溶けやすく、エタノール（95）に溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

水溶液（1 → 20）は旋光性を示さない。

1.0g を新たに煮沸して冷却した水 20mL に溶かした液の pH は 6.5 ～ 8.5 である。

22. 包装

100g × 5 本

23. 主要文献

1) 社内資料：生物学的同等性試験

2) 菅原幸子ほか：臨床医薬 2006；22（4）：311-326

- 3) 菅原幸子ほか：臨床医薬 2006；22（5）：393-409
- 4) 菅原幸子ほか：臨床医薬 2007；23（1）：55-71
- 5) 変形性膝関節症に対する一般臨床試験（ロキソニンパップ：2006年1月23日承認、申請資料概要ト.1-4-6）
- 6) 菅原幸子ほか：臨床医薬 2006；22（5）：411-426
- 7) 菅原幸子ほか：臨床医薬 2007；23（2）：127-141
- 8) 菅原幸子ほか：臨床医薬 2006；22（5）：427-442
- 9) 薬理作用発現に対する組織内濃度からの考察（ロキソニンパップ：2006年1月23日承認、申請資料概要ホ.3）
- 10) 浜本哲和ほか：臨床医薬 2006；22（3）：179-186
- 11) ラット足蹠イースト誘発疼痛に対する鎮痛作用（ロキソニンパップ：2006年1月23日承認、申請資料概要ホ.2-1）
- 12) ラットアジュバント関節炎疼痛に対する鎮痛作用（ロキソニンパップ：2006年1月23日承認、申請資料概要ホ.2-2）

24. 文献請求先及び問い合わせ先

辰巳化学株式会社 薬事・学術課
〒921-8164 金沢市久安3丁目406番地
TEL 076-247-2132
FAX 076-247-5740

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元



辰巳化学株式会社

金沢市久安3丁目406番地